

(19)世界知的所有権機関
国際事務局(43)国際公開日
2002年5月23日 (23.05.2002)

PCT

(10)国際公開番号
WO 02/40478 A1(51)国際特許分類1: C07D 471/04, 401/04, 498/04,
C07K 5/06, 5/10, A61K 31/4375, 31/4709, 31/5383,
38/05, 38/06, 31/04区北葛西一丁目16番13号 第一薬業株式会社 東京研
究開発センター内 Tokyo (JP).

(21)国際出願番号: PCT/JP01/10086

(74)代理人:弁理士 小栗昌平, 外(OGURI, Shohei et al.);
〒107-6028 東京都港区赤坂一丁目12番32号 アーク
森ビル28階 栄光特許事務所 Tokyo (JP).

(22)国際出願日: 2001年11月19日 (19.11.2001)

(81)指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO,
NZ, OM, PII, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL,
TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(25)国際出願の言語: 日本語

(84)指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ヨーラシア特許
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特
許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BI, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(26)国際公開の言語: 日本語

添付公開書類:
— 国際調査報告書(30)優先権データ:
特願2000-3522692000年11月20日 (20.11.2000) JP
特願2001-248822 2001年8月20日 (20.08.2001) JP2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイドスノート」を参照。(71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 第一
製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [JP/IP]; 〒103-0027 東京都中央区日本橋三丁目
14番10号 Tokyo (JP).

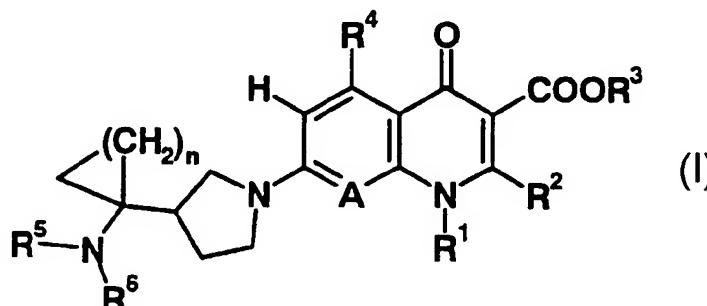
(72)発明者; および

(75)発明者/出願人(米国についてのみ): 高橋 寿 (TAKA-
HASHI, Hisashi) [JP/IP], 宮内理江 (MIYAUCHI, Rie)
[JP/IP], 伊藤雅夫 (ITOH, Masao) [JP/IP], 竹村
真 (TAKEMURA, Makoto) [JP/IP], 早川勇夫
(HAYAKAWA, Isao) [JP/IP]; 〒134-0081 東京都江戸川

(54)Title: DEHALOGENO COMPOUNDS

(54)発明の名称: デハロゲノ化合物

WO 02/40478 A1



VRE. Thus, these compounds are usable as drugs.

(57)Abstract: 3-(1-Aminocycloalkyl)pyrrolidinyl-substi-
tuted-6-dehalogeno(hydro-
gen-substituted)quinolonecar-
boxylic acid derivatives
having specific substituents as
represented by the following
general formula (I), salts thereof
and hydrates of the same exhibit
a broad and potent antibacterial
activity on gram-negative and
gram-positive bacteria, in
particular, resistant bacteria
typified by gram-positive cocci
including MRSA, PRSP and

[統葉有]

BEST AVAILABLE COPY



BEST AVAILABLE COPY

(57) 要約:

特定の置換基を有する下記一般式(I)で表される構造の3-(1-アミノシクロアルキル)ピロリジニル置換-6-デハロゲノ(水素置換)キノロンカルボン酸誘導体、その塩、およびそれらの水和物が、グラム陰性菌およびグラム陽性菌に対して幅広い強力な抗菌活性を示すこと、とりわけMRSA、PRSP、およびVREを含むグラム陽性球菌に代表される耐性菌に対して強力な抗菌活性を示し、薬剤として用いられる。

